(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 28. April 2005 (28.04.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 2005/037829 A1

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 413/12, 263/58, A61K 31/423, A61P 35/00

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/009743

(22) Internationales Anmeldedatum:

1. September 2004 (01.09.2004)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 103 44 223.5 24. September 2003 (24.09.2003) I

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): MERCK PATENT GMBH [DE/DE]; Frankfurter Str. 250, 64293 Darmstadt (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): STÄHLE, Wolgang [DE/DE]; Neuweg 14c, 55218 Ingelheim (DE). JONCZYK, Alfred [DE/DE]; Schepp Allee 57, 64295 Darmstadt (DE). RAUTENBERG, Wilfried [DE/DE]; Magdeburger Strasse 13, 64354 Reinheim (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: MERCK PATENT GMBH; Frankfurter Str. 250, 64293 Darmstadt (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: 1,3-BENZOXAZOLYL DERIVATIVES AS KINASE-INHIBITORS

(54) Bezeichnung: 1,3-BENZOXAZOLYLDERIVATE ALS KINASE-INHIBITOREN

$$(R^{1})_{n} \xrightarrow{N} \overset{H}{\longrightarrow} (R^{2})_{m}$$

$$(R^{3})_{p}$$

$$(I)$$

(57) Abstract: The invention relates to compounds of formula 1, the production and use thereof as a medicament for the treatment of diseases, particularly tumours and/or diseases caused, mediated or propagated by angiogenesis. The compounds of formula 1 are effective inhibitors of tyrosin kinases, particularlyTIE-2 and VEGFR, and Raf-kinases. (I)

(57) Zusammenfassung: Verbindungen der Formel 1, deren Herstellung und Verwendung zur Herstellung eines Medikaments zur Behandlung von Krankheiten, insbesondere Tumoren und/oder Krankheiten, die durch Angiogenese verursacht, vermittelt und/oder

propaffiert werden. Verbindungen der Formel 1 sind wirksame Inhibitoren der Tyrosinkinasen, insbesondere TIE-2 und..VEGFR, und der Raf-Kinasen. (I)

WO 2005/037829 A1